

COMPOSITION CONTAINING COENZYME Q10 AND ITS PERPARATION

Publication number: JP55081813
 Publication date: 1980-06-20
 Inventor: SEO HIROSHI
 Applicant: NISSHIN FLOUR MILLING CO
 Classification:
 - international: A61K9/48; A61K9/10; A61K31/12; A61K47/00;
 A61K9/48; A61K9/10; A61K31/12; A61K47/00; (IPC1-
 7): A61K9/10
 - European:
 Application number: JP19780154609 19781216
 Priority number(s): JP19780154609 19781216

Report a data error here

Abstract of JP55081813

PURPOSE:Coenzyme Q10 that is useful as a medicine is dissolved in a neutral oil in the presence of a surfactant, thus producing said composition for filling soft capsules with long-term stability and high handleability. CONSTITUTION:Coenzyme Q10 is mixed with a neutral oil as soybean or corn oil and a surfactant as sorbitan monolaurate and dissolved in them, wherein heating the mixture over 70 deg.C results in remarkably increased stability of the solution. The amount of the neutral oil used is over 5 times that of the coenzyme Q10 employed, preferably 10-20 times and that of the surfactant is 0.01-2, preferably 0.05-1 time. The resulting composition is a stable solution so that it precipitates no crystals even when stored for a long time and can be filled in soft capsules because of its high flowability. Coenzyme Q10 concerns itself with the electron transport system in vivo and shows outstandingly pharmaceutical effects on various kinds of diseases.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—81813

⑤ Int. Cl.³

A 61 K 9/10

識別記号

庁内整理番号
7057—4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)6月20日

発明の数 2

審査請求 未請求

(全 4 頁)

⑭ 補酵素 Q₁₀ 含有組成物およびその製法

⑯ 特 願 昭53—154609
 ⑰ 出 願 昭53(1978)12月16日
 ⑱ 発 明 者 瀬尾宏

川越市砂新田2591の54
 ⑲ 出 願 人 日清製粉株式会社
 東京都中央区日本橋小網町19番
 12号
 ⑳ 代 理 人 弁理士 山下白

明 細 書

1. 発明の名称 補酵素 Q₁₀ 含有組成物およびその製法

2. 特許請求の範囲

- 1) 補酵素 Q₁₀、中性油および界面活性剤を含有することを特徴とする、ソフトカプセル元項用補酵素 Q₁₀ 含有組成物。
- 2) 補酵素 Q₁₀、中性油および界面活性剤を70℃以上に加熱することを特徴とする、ソフトカプセル元項用補酵素 Q₁₀ 含有組成物の製法。

3. 発明の詳細な説明

本発明は、ソフトカプセル元項用補酵素 Q₁₀ 含有組成物およびその製法に関する。

補酵素 Q₁₀ は生体内では電子伝達系に関与して各種疾病に対して優れた薬理効果を示す物質である。この補酵素 Q₁₀ を医薬品として提供する場合に種々の剤型が考えられるが、補酵素 Q₁₀

の融点がほぼ50℃と低いために例えば錠剤にした場合には打錠時に補酵素 Q₁₀ が融融して錠剤の表面に滲出し商品価値を低下せしめる。また、ハードカプセルにした場合にも、錠形剤に吸着された薬物が保存時に溶融分離するという欠点がある。そこで本発明者らは、この補酵素 Q₁₀ をソフトカプセル化することを試みたが短時間において補酵素 Q₁₀ の結晶が析出して溶液の流動性が失われソフトカプセル化が不可能となり、あるいはソフトカプセルが製造できたとしても、保存中に補酵素 Q₁₀ の結晶が析出して体内における吸収が悪くなるというような欠点があった。

そこで本発明者らは長期間安定な補酵素 Q₁₀ の溶液を得るべく研究を重ねた結果、補酵素 Q₁₀ を中性油に溶解するにあたり、界面活性剤を存在せしめることによつて長期間安定な溶液が得

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—81813

⑤ Int. Cl.³
A 61 K 9/10

識別記号

庁内整理番号
7057—4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)6月20日

発明の数 2
審査請求 未請求

(全 4 頁)

⑭ 補酵素Q₁₀含有組成物およびその製法⑮ 特 願 昭53—154609
⑯ 出 願 昭53(1978)12月16日
⑰ 発 明 者 瀬尾宏川越市砂新田2591の54
⑱ 出 願 人 日清製粉株式会社
東京都中央区日本橋小網町19番
12号
⑲ 代 理 人 弁理士 山下白

明 細 書

1 発明の名称 補酵素Q₁₀含有組成物およびそ
の製法

2 特許請求の範囲

- 1) 補酵素Q₁₀、中性油および界面活性剤を含有することを特徴とする、ソフトカプセル充填用補酵素Q₁₀含有組成物。
- 2) 補酵素Q₁₀、中性油および界面活性剤を70℃以上に加熱することを特徴とする、ソフトカプセル充填用補酵素Q₁₀含有組成物の製法。

3 発明の詳細な説明

本発明は、ソフトカプセル充填用補酵素Q₁₀含有組成物およびその製法に関する。

補酵素Q₁₀は生体内では電子伝達系に関与して各種疾病に対して優れた薬理効果を示す物質である。この補酵素Q₁₀を医薬品として提供する場合に種々の剤型が考えられるが、補酵素Q₁₀

の融点がほぼ50℃と低いために例えば錠剤にした場合には打錠時に補酵素Q₁₀が溶融して錠剤の表面に滲出し商品価値を低下せしめる。また、ハードカプセルにした場合にも、賦形剤に吸着された薬物が保存時に溶融分離するという欠点がある。そこで本発明者らは、この補酵素Q₁₀をソフトカプセル化することを試みたが短時間において補酵素Q₁₀の結晶が析出して溶液の流動性が失われソフトカプセル化が不可能となり、あるいはソフトカプセルが製造できたとしても、保存中に補酵素Q₁₀の結晶が析出して体内における吸収が悪くなるというような欠点があった。

そこで本発明者らは長期間安定な補酵素Q₁₀の溶液を得るべく研究を重ねた結果、補酵素Q₁₀を中性油に溶解するにあたり、界面活性剤を存在せしめることによつて長期間安定な溶液が得

	3日目	6日目	9日目	12日目
本発明(1)	○	○	○	△
本発明(2)	○	○	○	○
対 照	○	×	×	×

(注) ○：結晶の析出が全く認められない状態

△：結晶が少々析出している状態

×：溶液全体に結晶が析出して流動性が全く失われている状態

以下に実施例により本発明を詳細に説明する。

実施例 1

補酵素 Q₁₀ 0.2 kg、中鎖脂肪酸トリグリセライド（ミグリオール 812、Dynamit Nobel 社製）2.00 kg、およびソルビタンセスキオレエート（80-15、日光ケミカルズ（株）製）0.02 kgを温度で 30 分間攪拌混合し、均一なソフトカプセル充填用補酵素 Q₁₀ 組成物を得る。

- 7 -

重量各 1.62 g のシームレスカプセルを製造した。

実施例 3

補酵素 Q₁₀ 0.02 kg および大豆白絞油 0.398 kg を 130℃ に加熱しつつ攪拌する。補酵素 Q₁₀ が溶解したところで攪拌を止め、溶液を 30℃ に冷却した後、ソルビタンモノラウレート（8L-10、日光ケミカルズ（株）製）0.02 kg を加えて更に攪拌してソフトカプセル充填用補酵素 Q₁₀ 組成物を得る。

この補酵素 Q₁₀ の溶液を加圧打抜き法ソフトカプセル製造機（Leiner & Sons 社製）を用いて内容物重量各 3.00 g のソフトカプセルを得た。なおソフトカプセルの製造に用いた剤皮配合はゼラチン 2 kg、グリセリン 0.4 kg、ソルビトール 0.2 kg および水 2.5 kg であり、剤皮の厚さは 10 μm とした。

実施例 4

この補酵素 Q₁₀ の溶液をカプセル型 Oval 3 を取りつけた打ち抜き法ソフトカプセル連続自動製造機（Leiner & Sons 社製）に供給し、内容物重量 1.02 g のソフトカプセルを得た。なおソフトカプセルの製造に用いた剤皮配合組成物はゼラチン 4.7 kg、グリセリン 1.8 kg および水 3.4 kg であり、剤皮の厚さは 11.9 μm とした。

実施例 2

補酵素 Q₁₀ 0.2 kg、とうもろこし油 3.0 kg およびソルビタンモノオレエート（TO-10、日光ケミカルズ（株）製）0.05 kg を攪拌混合しつつ 100℃ まで加熱して補酵素 Q₁₀ を溶解する。この溶液を約 30℃ まで冷却し、ソフトカプセル充填用補酵素 Q₁₀ 組成物を得る。

次に実施例 1 と同様の剤皮配合組成のゼラチン溶液を使用する二重円筒式カプセル製造機（Globex International 社製）によつて内容物

- 8 -

補酵素 Q₁₀ 1.0 g、中鎖脂肪酸トリグリセライド（ミグリオール 812、Dynamit Nobel 社製）5.5 g およびソルビタンセスキオレエート（80-15、日光ケミカルズ（株）製）0.2 g を攪拌混合しつつ 100℃ に加熱して補酵素 Q₁₀ を溶解する。この溶液を 30℃ に冷却してソフトカプセル充填用補酵素 Q₁₀ 組成物を得る。

この補酵素 Q₁₀ の溶液を打ち抜き法ソフトカプセル連続自動製造機（Leiner & Sons 社製）で内容物重量各 9.55 g のソフトカプセルを得た。なおソフトカプセル製造に用いた剤皮は実施例 3 と同様にした。

実施例 5

補酵素 Q₁₀ 1.0 g、中鎖脂肪酸エステル（ミグリオール 812、Dynamit Nobel 社製）15.0 g およびポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート 1 g を 100℃ で 5 分間攪拌混合して補酵

素 Q10 を完全に溶解させる。この液を室温まで
冷却した後平板打ち抜き法により 1 カプセル当
り内容物 161mg 含有するソフトカプセルを得た。

特許出願人 日清製粉株式会社

代理人 弁理士 山下 白